



**Nombre de alumnos: José David Hernández Santis**

**Nombre del profesor: CLAUDIA GUADALUPE FIGUEROA**

**Nombre del trabajo: ANTIBIÓTICOS BETALACTÁMICOS**

**Materia: FARMACOLOGÍA**

**PASIÓN POR EDUCAR**

**Grado: 3er cuatrimestre**

**Grupo: A**

Comitán de Domínguez Chiapas a 10 de JULIO de 2020

COMPUESTOS BETALACTÁMICOS

PENICILINAS

Química

Clasificación

penicilinas

Estas tienen una actividad máxima frente a organismos grampositivos, cocos gramnegativos y anaerobios que no producen betalactamasas, sin embargo, tiene poca actividad contra bacilos gramnegativos y son susceptibles a la hidrólisis por las betalactamasas

Penicilina antiestafilococicas

Estas penicilinas son resistentes a las betalactamasas estafilocócicas. Son activos contra los estafilococos y los estreptococos, pero no contra los enterococos, las bacterias anaerobias y los cocos y bacilos gramnegativas

Penicilina de amplio espectro

Estos fármacos retienen el espectro antibacteriano de la penicilina y tiene actividad mejorada contra los bacilos gramnegativas. Al igual que la penicilina, sin embargo, son relativamente susceptible a la hidrólisis de las betalactamasas

Unidades y formulación de penicilina

La actividad de la penicilina G se definió originalmente en unidades. La penicilina G sódica cristalina contiene aproximadamente 1600 unidades por mg. Las penicilinas semisintéticas se recetan por peso en lugar de por unidades. La concentración inhibitoria mínima de cualquier penicilina generalmente se administra en mcg/mL. La mayoría de las penicilinas están formuladas como la sal de sodio o potasio de ácido libre. La penicilina G de potasio contiene aproximadamente 1.7 mEq de K<sup>+</sup> por millón de unidades de penicilina. La nafcilina contiene Na<sup>+</sup>, 2.8mEq/g. las sales de la procaína y las sales de benzatina de la penicilina G proporcionan formas de depósito para inyección intramuscular. En forma cristalina seca, las sales de penicilina son estables durante a 4 °C. las soluciones pierden su actividad rápidamente y debe prepararse frescas para la administración

Mecanismos de acción

Las penicilinas, como todos los antibióticos betalactámicos, inhiben el crecimiento bacteriano al interferir con la reacción de transpeptidación de la síntesis de la pared celular bacteriana. La pared celular es la capa externa rígida que rodea completamente la membrana citoplasmática, mantiene la integridad celular y previene la lisis celular de la presión osmótica alta.

Resistencia

Las resistencias de las penicilinas y otros betalactámicos se debe a uno de los cuatro mecanismos generales: 1) inactivación de antibiótico por betalactamasa, 2) modificación de PBP blanco. 3) penetración alterada del fármaco a PBP blanco y 4) flujo de salida de antibiótico. La producción de betalactamasa es el mecanismo más común de resistencia

Farmacocinética

La absorción del fármaco administrado por vía oral difiere en gran medida para las penicilinas individuales, dependiendo en parte de su estabilidad ácida y unión a proteínas. La absorción gastrointestinal de la nafcilina es errática por lo que no es adecuada para la administración oral. La dicloxacilina, ampicilina y amoxicilina son estables en ácido y relativamente bien absorbidas, produciendo concentraciones séricas en el rango de 4-8 mcg/mL después de una dosis oral de 500 mg. La absorción de la mayoría de las penicilinas orales se altera por los alimentos y los medicamentos deben administrarse al menos 1-2 horas antes o después de una comida.  
La administración intravenosa de penicilina G es preferible a la vía intramuscular debido a la irritación y el dolor local por la inyección de grandes dosis intramusculares.

Usos clínicos

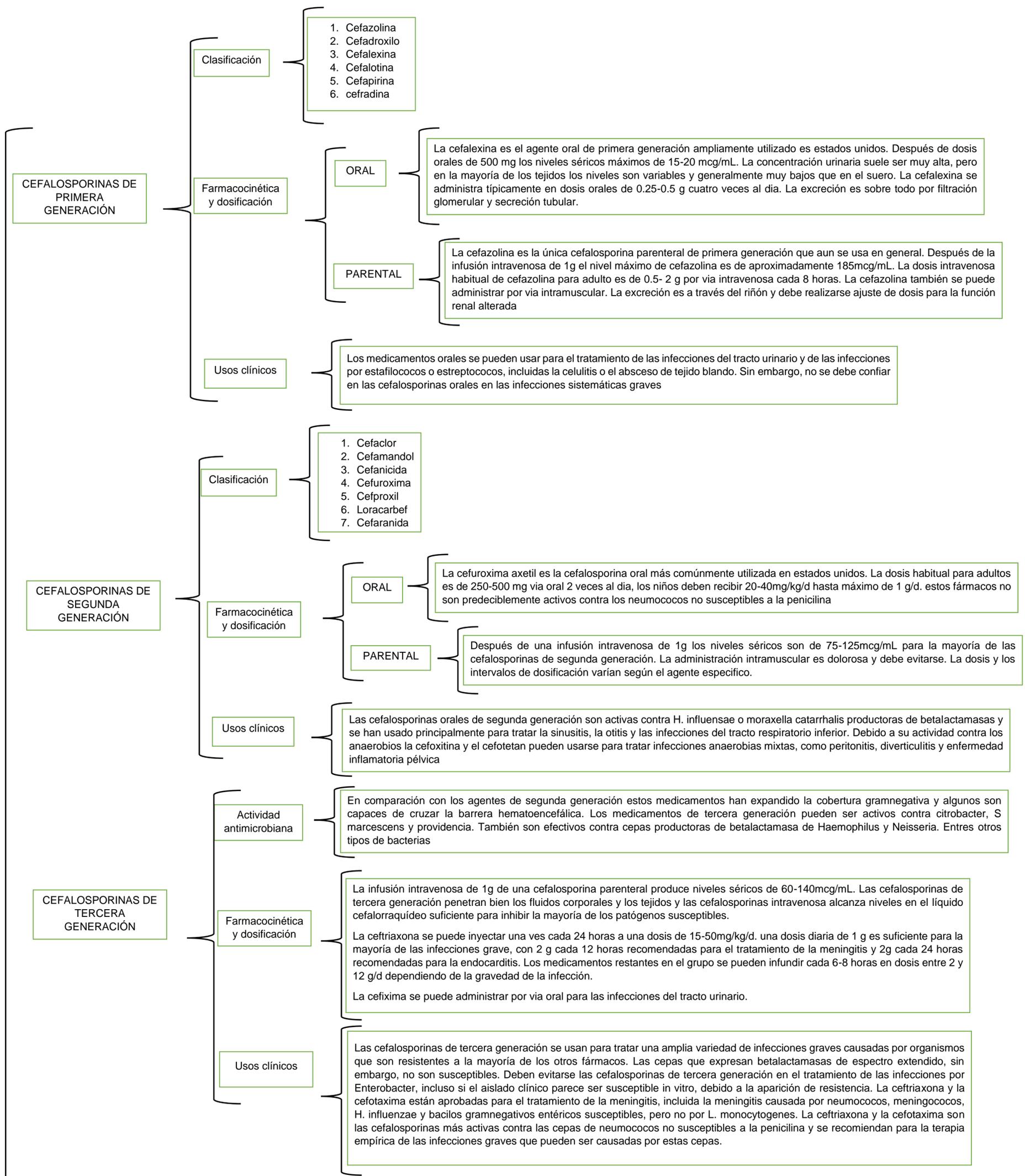
La excepción de la amoxicilina, las penicilinas orales deben administrarse 1-2 horas antes o después de una comida; no debe administrarse con alimento para minimizar la unión a las proteínas de los alimentos y la inactivación ácida. La amoxicilina puede administrarse independientemente de las comidas. Los niveles sanguíneos de todas las penicilinas pueden aumentarse mediante la administración simultánea de probenecid 0.5 cada 6 horas por vía oral lo que afecta la secreción tubular renal de ácidos débiles como los compuestos betalactámicos. Las penicilinas como todos los antibióticos antibacterianos nunca deben usarse para infecciones virales y debe prescribirse solo cuando existe una sospecha razonable de o una infección documentada con organismos susceptibles

Reacciones adversas

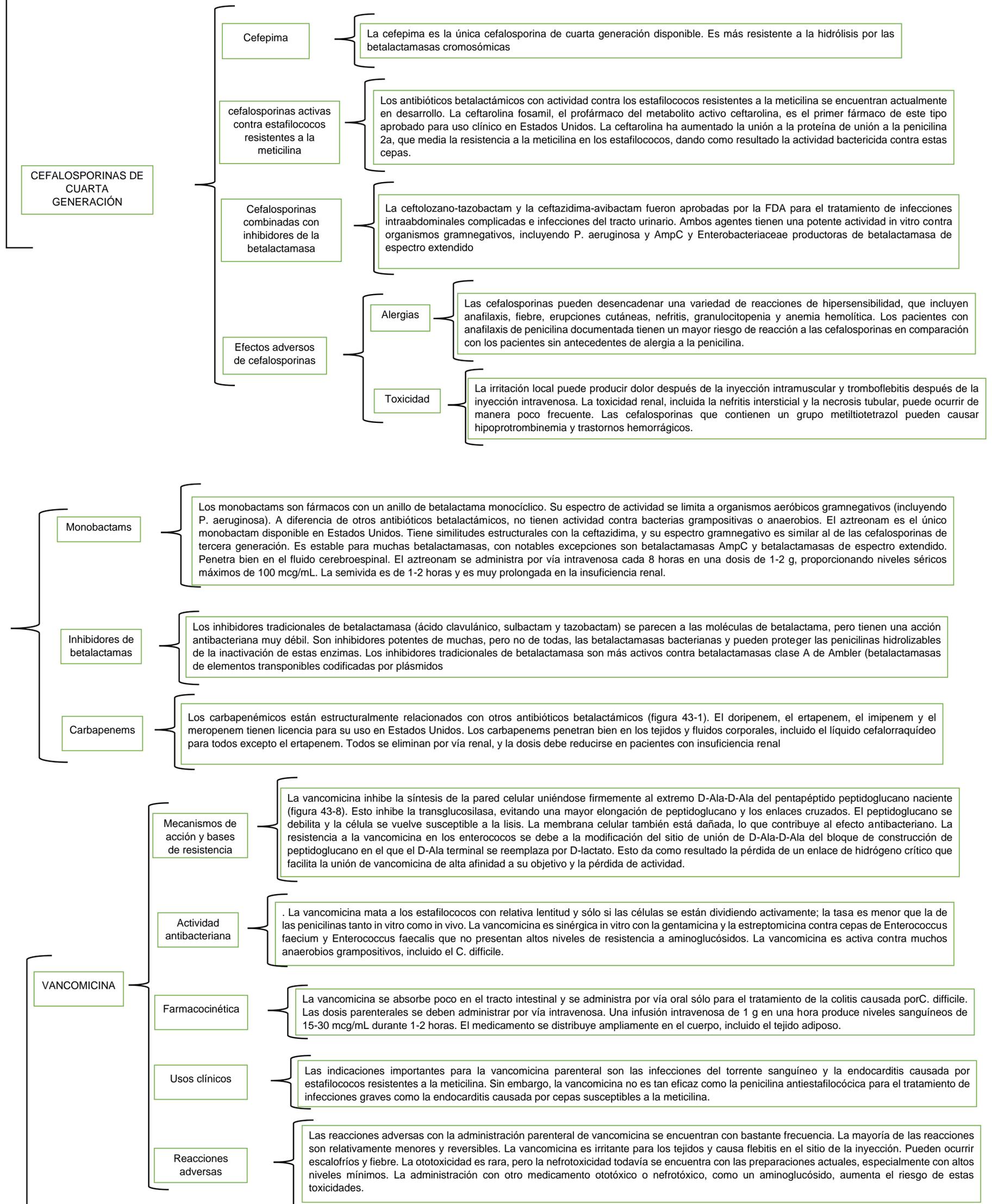
Las penicilinas por lo general son toleradas y desafortunadamente esto puede alentar su uso inadecuado. La mayoría de los efectos adversos se deben a la hipersensibilidad. Los determinantes antigénicos son producto de degradación de las penicilinas particularmente el ácido penicilínico y productos de hidrólisis alcalina unidos a proteínas del hospedador. Sin embargo, debido al potencial de anafilaxia, la penicilina debe administrarse con precaución o debe administrarse un medicamento sustantivo si la persona tiene antecedentes de alergia grave al fármaco. La prueba de la piel con penicilina también se puede usar para evaluar la hipersensibilidad de tipo 1.  
Las reacciones alérgicas incluyen choque anafiláctico, reacciones de tipo de enfermedad del suero, y una variedad de erupciones en la piel. También puede ocurrir lesiones orales, fiebre, nefritis intersticial, eosinofilia, anemia hemolítica y otras alteraciones hematológicas  
En pacientes con insuficiencia renal la penicilina en dosis altas puede causar convulsiones. La nafcilina se asocia con neutropenia y nefritis intersticial; la oxacilina puede causar hepatitis y la metilina comúnmente causa nefritis intersticial  
La penicilina en vía oral puede provocar malestar gastrointestinal, especialmente náuseas, vómito y diarrea. La ampicilina se ha asociado con colitis pseudomembranosa. La ampicilina y la amoxicilina pueden asociarse con erupciones cutáneas cuando se prescribe en el contexto de enfermedades virales, particularmente durante la infección aguda por el virus de Epstein-Barr, pero la incidencia de erupción cutánea puede ser inferior a la informada originalmente

# ANTIBIÓTICOS BETA-LACTÁMICOS

## CEFALOSPORINAS Y CEFAMICINAS



## OTROS MEDICAMENTOS BETALACTÁMICOS



ANTIBIÓTICOS  
GLUCOPÉPTIDOS

TEICoplanina

La teicoplanina es un antibiótico glucopéptido muy similar a la vancomicina en el mecanismo de acción y el espectro antibacteriano. A diferencia de la vancomicina, puede administrarse por vía intramuscular o intravenosa. La teicoplanina tiene una semivida larga (45-70 horas), lo que permite una dosificación una vez al día.

TELAVANCINA

La telavancina es un lipogluco péptido semisintético derivado de la vancomicina. Es activo frente a bacterias grampositivas y tiene actividad in vitro contra muchas cepas con susceptibilidad reducida a la vancomicina. Tiene dos mecanismos de acción. Al igual que la vancomicina, inhibe la síntesis de la pared celular uniéndose al extremo D-Ala-D-Ala del peptidoglucano en la pared celular en crecimiento. Además, interrumpe el potencial de la membrana celular bacteriana y aumenta la permeabilidad de la membrana. La semivida de la telavancina es de aproximadamente 8 horas, lo que permite una dosificación intravenosa una vez al día.

DALBAVANCINA  
Y  
ORITAVANCINA

La dalbavancina y la oritavancina son lipogluco péptidos semisintéticos derivados de la teicoplanina. Inhiben la síntesis de la pared celular a través del mismo mecanismo de acción que la vancomicina y la teicoplanina.

AGENTES  
ACTIVOS EN LA  
MEMBRANA O LA  
PARED CELULAR

DAPTOMICINA

La daptomicina es un nuevo producto de fermentación de lipopéptido cíclico de *Streptomyces roseosporus*. Su espectro de actividad es similar al de la vancomicina, excepto que puede ser activo contra cepas de enterococos resistentes a la vancomicina y *S. aureus*. In vitro tiene una actividad bactericida más rápida que la vancomicina. El mecanismo de acción preciso no se comprende completamente, pero se sabe que se une a la membrana celular a través de la inserción dependiente de calcio de su cola lipídica. Esto da como resultado la despolarización de la membrana celular con eflujo de potasio y muerte celular rápida.

FOSFOMICINA

La fosfomicina trometamol, una sal estable de fosfomicina (fosfonomicina), inhibe una etapa muy temprana de la síntesis de la pared celular bacteriana. Un análogo de fosfoenolpiruvato, estructuralmente no está relacionado con ningún otro agente antimicrobiano. Inhibe la enzima citoplásmica enolpiruvato transferasa uniéndose covalentemente al residuo de cisteína del sitio activo y bloqueando la adición de fosfoenolpiruvato a UDP-N-acetilglucosamina. Esta reacción es el primer paso en la formación del ácido UDP-N-acetilmurámico, el precursor del ácido N-acetilmurámico, que se encuentra sólo en las paredes de las células bacterianas. El fármaco se transporta a la célula bacteriana mediante sistemas de transporte de glicerofosfato o glucosa 6-fosfato. La resistencia se debe a un transporte inadecuado del medicamento a la célula.

BACITRACINA

La bacitracina es una mezcla de péptidos cíclicos obtenida por primera vez de la cepa Tracy de *Bacillus subtilis* en 1943. Es activa contra microorganismos grampositivos. La bacitracina inhibe la formación de la pared celular al interferir con la desfosforilación en el ciclo del transportador de lípidos que transfiere las subunidades de peptidoglucanos a la pared celular en crecimiento. No existe resistencia cruzada entre la bacitracina y otros fármacos antimicrobianos. La bacitracina es muy nefrotóxica cuando se administra sistémicamente y sólo se usa de manera tópica. Se absorbe poco y la aplicación tópica produce actividad antibacteriana local.

CICLOSERINA

La cicloserina es un antibiótico producido por *Streptomyces orchidaceus*. Es soluble en agua y muy inestable a pH ácido. La cicloserina inhibe muchos organismos grampositivos y gramnegativos, pero se usa casi exclusivamente para tratar la tuberculosis causada por cepas de *Mycobacterium tuberculosis* resistentes a los agentes de primera línea. La cicloserina es un análogo estructural de la D-alanina e inhibe la incorporación de D-alanina en el pentapéptido de peptidoglucano al inhibir la alanina racemasa, que convierte la L-alanina en D-alanina, y la D-alanil-D-alanina ligasa.